

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2004年4月1日 (01.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2004/026842 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 239/54, 405/06, 405/12,  
405/14, A61K 31/513, A61P 17/04, 37/08

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/011859

(22) 国際出願日: 2003年9月17日 (17.09.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-274559 2002年9月20日 (20.09.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友製薬株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-8510 大阪府 大阪市 中央区道修町 2丁目2-8 Osaka (JP). 井上 善文 (INOUE, Yoshifumi) [JP/JP]; 〒554-0022 大阪府 大阪市 此花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会社内 Osaka (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 磯部 義明 (ISOBE, Yoshiaki) [JP/JP]; 〒554-0022 大阪府 大阪市 此花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 戸辺 雅則 (TOBE, Masanori) [JP/JP]; 〒554-0022

大阪府 大阪市 此花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 磯部 真一 (ISOBE, Masakazu) [JP/JP]; 〒554-0022 大阪府 大阪市 此花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 五十部 穂 (ISOBE, Yutaka); 〒554-0022 大阪府 大阪市 此花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会社 知的財産部内 Osaka (JP).

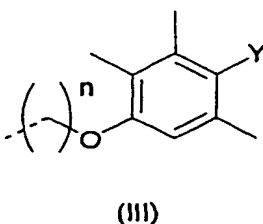
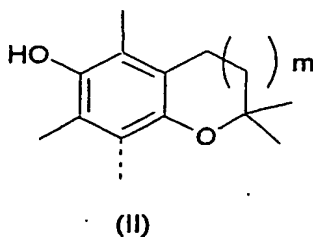
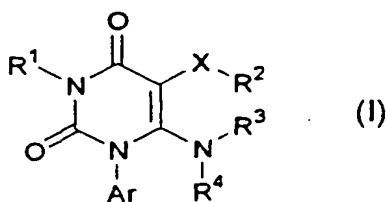
(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

/ 続葉有 /

(54) Title: NOVEL URACIL DERIVATIVES AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: 新規ウラシル誘導体及びその医薬用途



(57) Abstract: It is intended to provide an uracil derivative represented by the following general formula (I): (I) wherein X represents a group selected from among NHCO, NHCH<sub>2</sub>, CO, CONH and CH<sub>2</sub>NH; R<sup>1</sup> represents hydrogen or optionally substituted C<sub>1-6</sub> alkyl; R<sup>2</sup> represents a group of the following general formula (II) or (III): (II) (III) (wherein m is 0 or 1; n is an integer of from 1 to 3; Y represents OH or NH<sub>2</sub>; and a dotted line shows a binding position), provided that when R<sup>2</sup> is a group of the general formula (III), X represents NHCO or NHCH<sub>2</sub>; R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> independently represent each hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl; and Ar represents phenyl substituted by C<sub>1-6</sub> alkyl at the o- and m-positions, optionally substituted heteroaryl or a bicyclic aromatic group; its pharmaceutically acceptable salt, and a remedy containing the above uracil derivative or its pharmaceutically acceptable salt as the active ingredient for, in particular, allergic diseases relating to a type IV allergic reaction, i.e., a novel compound useful in treating diseases in which a type IV allergic reaction participates and a remedy

for allergic diseases containing the same as the active ingredient.

/ 続葉有 /

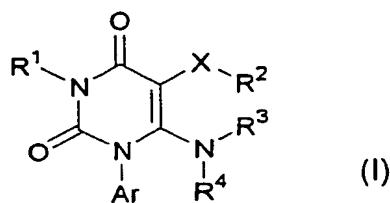


添付公開書類：  
— 国際調査報告書

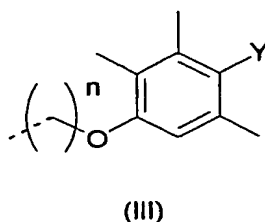
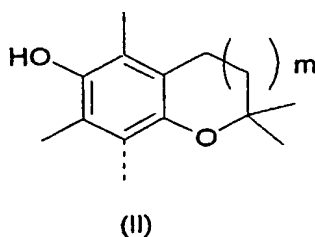
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

一般式 (I) :



[式中、XはNHCO、NHCH<sub>2</sub>、CO、CONH及びCH<sub>2</sub>NHから選ばれる基を示し、R<sup>1</sup>は水素原子又は炭素数1～6の置換もしくはは無置換のアルキル基を示し、R<sup>2</sup>は一般式(II)又は(III) :



(式中、mは0又は1を示し、nは1～3の整数を示し、YはOH又はNH<sub>2</sub>を示し、点線は結合位置を示す。)を示し、但しR<sup>2</sup>が一般式(III)を示す場合、XはNHCO又はNHCH<sub>2</sub>を示し、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は独立して水素原子又は炭素数1～6のアルキル基を表し、Arはo位およびm位に炭素数1～6のアルキルが置換したフェニル基、置換もしくはは置換のヘテロアリール基又は2環性芳香族基を示す。]

で示されるウラシル誘導体又はその薬学的に許容される塩、及び前記ウラシル誘導体又はその薬学的に許容される塩を有効成分とする、特にIV型アレルギー反応が関与するアレルギー性疾患の治療薬で、種々のアレルギー性疾患、特にIV型アレルギー反応が関与する疾患の治療に有用な新規な化合物及びこれを有効成分とするアレルギー性疾患治療薬を提供すること。